#### (19) 世界知的所有権機関 国際事務局

# HIPO PMPI

### 

#### (43) 国際公開日 2002 年11 月28 日 (28.11.2002)

#### **PCT**

#### (10) 国際公開番号 WO 02/094766 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 233/66, 233/75, 233/76, 233/80, 233/81, 237/42, 255/60, 311/08, 311/39, 317/40, 323/29, 323/37, 233/75, A01N 37/30, 37/40, 41/06, 41/10, 43/40

(21) 国際出願番号:

PCT/JP02/04744

(22) 国際出願日:

2002年5月16日 (16.05.2002)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2001-149407 2001年5月18日(18.05.2001) JP

(71) 出願人 *(*米国を除く全ての指定国について*)*: 日本農薬 株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒 103-8236 東京都 中央区 日本橋 1 丁目 2番 5 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 後藤 誠 (GOTO,Makoto) [JP/JP]; 〒225-0002 神奈川県 横浜市青葉区美しが丘1-13-6-2-1-406 Kanagawa (JP). 清水寿明 (SHIMIZU,Toshiaki) [JP/JP]; 〒586-0001 大阪府河内長野市木戸3丁目13-1-303 Osaka (JP). 遠西正範 (TOHNISHI,Masanori) [JP/JP]; 〒599-8241 大阪府堺市福田1040-1-408 Osaka (JP). 瀬尾明 (SEO,Akira) [JP/JP]; 〒648-0092 和歌山県 橋本市紀見ヶ丘2-3-19 Wakayama (JP). 森本 雅之 (MORIMOTO,Masayuki)

[JP/JP]; 〒586-0024 大阪府河内長野市西之山町 1-28-305 Osaka (JP). 藤岡伸祐 (FUJIOKA,Shinsuke) [JP/JP]; 〒586-0037 大阪府河内長野市上原町 474-1-103 Osaka (JP).

- (74) 代理人: 浅村 皓 , 外(ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒 100-0004 東京都 千代田区 大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 /広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

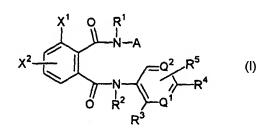
#### 添付公開書類:

#### — 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PHTHALAMIDE DERIVATIVE, AGRICULTURAL OR HORTICULTURAL INSECTICIDE, AND USE THEREOF

(54) 発明の名称: フタルアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



the compound as the active ingredient.

(57) Abstract: A phthalamide derivative represented by the general formula (I): (I) (wherein R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> may be the same or different and each represents hydrogen, C<sub>1-6</sub> alkyl, etc.; R<sup>3</sup> represents halogeno, cyano, etc.; R<sup>4</sup> represents halogeno, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, etc.; R<sup>5</sup> represents hydrogen, halogeno, etc.; Q<sup>1</sup> and Q<sup>2</sup> may be the same or different and each represents carbon or nitrogen; X<sup>1</sup> represents halogeno, nitro, etc. and X<sup>2</sup> represents hydrogen, halogeno, etc., provided that X<sup>1</sup> and X<sup>2</sup> in combination may form a fused ring; and A represents any of A1 to A4); and an agricultural or horticultural insecticide containing

		•

#### (57) 要約:

#### 本発明は、一般式(I)

(式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_1$   $-C_6$  アルキル基等を示し; $R^3$ はハロゲン原子、シアノ基等を示し、 $R^4$ はハロゲン原子、ハロ $C_1$   $-C_6$  アルキル基等を示し; $R^5$  は水素原子、ハロゲン原子等を示し; $Q^1$  及び $Q^2$  は同一又は異なっても良くC 又はN を示し; $X^1$  はハロゲン原子、ニトロ基等を示し; $X^2$  は水素原子、ハロゲン原子等を示し; $X^2$  は水素原子、ハロゲン原子等を示し; $X^1$  及び $X^2$  は一緒になって縮合環を形成することができ;A はA 1 -A 4 を示す)で表されるフタルアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする、農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関する。

1

#### 明 細 書

#### フタルアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

#### 5 技術分野

本発明はフタルアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

#### 背景技術

特開昭60-8247号公報に本発明のフタルアミド誘導体に類似した化合物 10 が農園芸用殺菌剤として有用であることが記載されている。又、米国特許第41 46386号公報には本発明のフタルアミド誘導体に類似した化合物が除草剤、 植物生長調節剤として有用であることが記載されている。

農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用薬剤、特に農園芸用殺 15 虫剤の開発が望まれている。又、就農者の老齢化等により各種の省力的施用方法 が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用薬剤の 創出が求められている。

#### 発明の開示

25

本発明者等は新規な農園芸用薬剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明 20 の一般式(I) で表されるフタルアミド誘導体が文献未記載の新規化合物であり、 農園芸用殺虫剤として有用であることを見いだし、本発明を完成させたものである。

即ち、本発明は一般式(I)

 $\{$ 式中、 $R^1$ 及び $R^2$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_3$ - $C_6$ アルケニル基、 $C_3$ - $C_6$ アルキニル基、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコ

キシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アル キル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコ キシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフ 5 ィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハ ロC1-C6アルキルスルホニル基又はC1-C6アルコキシカルボニル基から選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₄アルキル基を示す。R³はハロ ゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ 基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、 10  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキ ルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基を示す。 $R^4$ はハロゲン原子、 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>9</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハ 15 ロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスル ホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を 有する置換フェノキシ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、 20 ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハ ロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルス ルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基 を有する置換ピリジルオキシ基を示す。 $R^5$ は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロ 25 キシ基、アミノ基、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア ルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ルチオ基を示す。又、 $R^3$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ より選ばれる芳香環上に隣接した2個の 置換基は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっ

ても良く、ハロゲン原子、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコ

キシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有することもできる。 $Q^1$ 及び $Q^2$ は同一又は異なっても良く、炭素原 子又は窒素原子を示す。

 $X^1$ はハロゲン原子、ニトロ基、アミノ基、シアノ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ C1-C6アルキル基、C2-C6アルケニル基、ハロC2-C6アルケニル基、C2-C6アルキニ ル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、 10 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア ルキルスルホニル基を示す。 $X^2$ は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、アミノ 基、シアノ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C2-C6アルケニル基、ハ ロCo-Coアルケニル基、Co-Coアルキニル基、ハロCo-Coアルキニル基、Co-Coアル コキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、ハロC1-C6アルキルチ オ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基を示す。又、X<sup>1</sup>及び  $X^2$ は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル 20 キルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有することもできる。

AはA1~A4

25

(式中、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル基、ハロ $C_2$ - $C_6$ アルキニル基、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、

フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、 メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニ 5 ル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択 される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても 良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニト ロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6 アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル 10 スルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル 基又はハロC1-C6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する 置換複素環基、 $-E-R^6$ (式中、Eは-O-、-S-又は-N( $R^7$ ) -(式中、 R<sup>1</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>- $C_6$ シクロアルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ $C_1$ -15 C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、同一又 は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノカルボニル基、C1-C6アルキルスルホニ ル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基、モノC1-C6アルキルアミノスルホニル基、 同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノスルホニル基、フェニルC1-C4ア ルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミ ノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフ ィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基又はC1-25 C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フ ェニル $C_1$ - $C_4$ アルキル基を示す。)を示し、 $R^6$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハ  $ロC_1-C_6$ アルキル基、 $C_3-C_6$ アルケニル基、ハロ $C_3-C_6$ アルケニル基、 $C_3-C_6$ アルキ ニル基、ハロC3-C6アルキニル基、C3-C6シクロアルキル基、C1-C6アルコキシC1-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基、同一又は異な

っても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、 ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスル 5 ホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC1-C4アルキル 基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカ プト基、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6ア ルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル 10 チオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ -C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ カルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC,-C, アルキル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6ア ルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルス ルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又 はC1-C6アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複 素環基、C1-C6アルキルカルボニル基、ハロC1-C6アルキルカルボニル基、C1-C6ア ルコキシカルボニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、同一又は異な っても良いジC1-C6アルキルアミノカルボニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノスルホニル基、同一 又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノスルホニル基、同一又は異なっても 良いジC1-C6アルコキシホスホリル基又は同一若しくは異なっても良いジC1-C6ア 25 ルコキシチオホスホリル基を示す。)、 $-G-R^8$ (式中、Gは $-SO_2-$ 、-SO-、-C (=O) -又は-C (=NO $-R^7$ ) - (式中、 $R^7$ は前記に同じ。) を示し、 $R^8$ は水素原子、ヒドロキシ基、アミノ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、 ハロC3-C6アルキニル基、C3-C6シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっ

ても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、 ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスル 5 ホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異な っても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、 ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア 10 ルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスル ホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基又はC1-C6アルコキシカルボニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換複素環基、C1-C6アルコキシ基、C1-C6 アルキルチオ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルアミノ基、モノC3-C6アルケニルアミノ基、同一又は異なっても良いジ 15 アルケニルアミノ基、モノC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルアミノ基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキルアミ ノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル スルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルホニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハ ロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコ キシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフ ィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、ハ 25 ロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、フェニルカルボニルアミ ノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メル カプト基、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6 アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキ

ルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカルボニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロケン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカカフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ストロスーとの置換基を環上に有する置換フェニルスルホニルアミノ基、複素環アミノ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカコィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルカニル共工に基本のは、ロロローを開発して、アルコキ

15  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環アミノ基を示す。)、- J-E-R<sup>6</sup>(式中、Jは $C_1$ - $C_6$ アルキレン基、 $C_2$ - $C_6$ アルケニレン基又は $C_2$ - $C_6$ アルキニレン基を示し、E及びR<sup>6</sup>は前記に同じ。)又は- J-G-R<sup>8</sup>(式中、J、G及びR<sup>8</sup>は前記に同じ。)を示す。

20 又、芳香環上に隣接した 2個の Yは一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオールスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基ンはハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有することもできる。

nは0~3の整数を示す。)を示す。)で表されるフタルアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

本発明のフタルアミド誘導体は各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適し、優れた防除活性を示す。

#### 発明を実施するための形態

本発明のフタルアミド誘導体の一般式(I) の定義において「ハロゲン原子」と は塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「n-」とはノルマル を、「s-」とはセカンダリーを、「t-」とはターシャリーを示し、「i-」 5 とはイソを示し、「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル」とは、例えばメチル、エチル、nープロピ ル、iープロピル、nーブチル、iーブチル、sーブチル、tーブチル、nーペ ンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6 個のアルキル基を示し、「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル」とは、同一又は異なっても良い 1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個 10 のアルキル基を示し、例えばトリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、パー フルオロエチル基、パーフルオロイソプロピル基、クロロメチル基、ブロモメチ ル基、1ーブロモエチル基、2、3ージブロモプロピル基等を例示することがで き、「C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン」とは、メチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレ ン、ジメチルメチレン、テトラメチレン、イソブチレン、ジメチルエチレン、へ 15 キサメチレン等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキレン基を示し、 「C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル」とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチ ル、シクロヘキシル等の炭素原子数3~6の脂環式アルキル基を示す。

「複素環基」とは、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子から選択される1以上の へテロ原子を有する5又は6員複素環基を示し、例えばピリジル基、ピリジンー 20 Nーオキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル 基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル 基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等を例示することができる。「縮合環」としては、例えばナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベングフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベンブオキサゾール、ベングチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等を例示することができる。

15

本発明のフタルアミド誘導体において、 $R^1$ 及び $R^2$ は好ましくは水素原子又は  $C_1$ - $C_6$ アルキル基を示し、特に好ましくは水素原子を示す。 $R^3$ は好ましくはハロゲン原子又は $C_1$ - $C_4$ アルキル基を示し、 $R^4$ は好ましくはハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基を示し、 $R^5$ は好ましくは水素原子又はハロゲン原子を示す。  $X^1$ は好ましくはハロゲン原子を示し、 $X^2$ は好ましくは水素原子を示す。

 $Q^1$ 及び $Q^2$ は好ましくは炭素原子を示す。Aは好ましくはA1又はA2を示し、 Yは好ましくは $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、カルバモイル基、サルファモイル基を示す。nは好ましくは1又は2を示す。

本発明の一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体は例えば、下記に図示する
10 製造方法により製造することができる。

(式中、A、 $R^1$ 、 $R^3$ ~ $R^5$ 、 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $X^1$ 及び $X^2$ は前記に同じ。H a 1 は ハロゲン原子を示す。)

一般式(II-1)で表されるフタル酸ハライド誘導体と一般式(III-1)で表される 20 アミン誘導体とを、塩基の存在下又は不存在下に不活性溶媒中で反応させること により、一般式(IV-1)で表されるイソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体を 単離し又は単離せずして、酸又は塩基の存在下若しくは不存在下に一般式(V)で 表されるアミン誘導体と不活性溶媒中で反応させることにより、一般式(I-1)で 表されるフタルアミド誘導体を製造することができる。

25 一般式(I)中のAの定義で、AがA1~A4を示し、A1~A4中のYがーG-R<sup>7</sup>を示す場合、Gが-SO-又は-SO<sub>2</sub>-を示す化合物は、Yが-E-R<sup>6</sup>を示し、Eが-S-を示す化合物を常法により、例えばm-クロロ過安息香酸、過酸化水素等の酸化剤で酸化反応を行うことにより製造することができる。1-1.一般式(II-1)→一般式(IV-1)

)

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないもの であれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩 化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベン ゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、

- 5 ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等の エステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、酢酸 等の酸類、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等 の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上 混合して使用することができる。
- 本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、一般式 10 (III-1) で表されるアミン類を過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間 は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良 い。

- 15 反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じ て再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造する ことができる。又、反応系から単離せずして、次の反応工程に供することも可能 である。
  - 一般式(II-1)で表されるフタル酸ハライド類はReagent for
- Organic Chemistry, Vol. 1, P263, Chemical Abstracts, Vol. 55, 449c及びJ. Org. Chem., 38, 2557 (1973) 等に記載の方法により製造す
  - 1-2. 一般式(IV-1)→一般式(I-1)

ることができる。

20

本反応で使用できる酸としては、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、 25 塩酸、硫酸等の無機酸類を例示することができ、その使用量は、一般式(IV-1)で 表されるフタルイソイミド誘導体に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選 択して使用すれば良い。塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の 有機塩基類、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナト

リウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は、一般式(IV-1)で表 されるフタルイソイミド誘導体に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択 して使用すれば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、(1-1)で例示の不活性溶媒を挙げることができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、一般式 (V) で表されるアミン類を過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間 は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良 10 い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じ て再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造する ことができる。

製造方法2.

12 (II-2) 5 (VI-1) R<sup>3</sup> (VI-2) 10  $(R^2=H)$  $(R^1=H)$ 縮合剤 縮合剤 (IV-1) 15 (M-2)

(式中、A、R<sup>1</sup>~R<sup>5</sup>、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は前記に同じ。) 20

一般式(II-2)で表されるフタル酸無水物誘導体と一般式(V) で表されるアミン 誘導体を、不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(VI-2)で表され るフタルアミド酸誘導体とし、該フタルアミド酸誘導体(VI-2)を単離し又は単離 せずして、 $R^1$  が水素原子を示すフタルアミド酸誘導体(VI-2)の場合、塩基の存 25 在下又は不存在下、縮合剤の存在下に不活性溶媒中で縮合反応を行い、一般式 (IV-2)で表されるイソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体(IV-2)を単離し又 は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(III-2) で表されるアミン誘導体 と反応させることにより、一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体を製造する ことができ、 $R^1$ が水素原子以外の置換基を示すフタルアミド酸誘導体(VI-2)の

場合、塩基の存在下又は不存在下、縮合剤の存在下に不活性溶媒中で一般式 (III-2) で表されるアミン誘導体と縮合させることにより、一般式(I) で表されるフタルアミド誘導体を製造することができる。

又、一般式(II-2)で表されるフタル酸無水物誘導体と一般式(III-2)で表されるアミン類を、不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(VI-1)で表されるフタルアミド酸誘導体とし、該フタルアミド酸誘導体(VI-1)を単離し又は単離せずして、R<sup>3</sup>が水素原子を示すフタルアミド酸誘導体(VI-1)の場合、塩基の存在下又は不存在下、縮合剤の存在下に不活性溶媒中で縮合反応を行い、一般式(IV-1)で表されるイソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体(IV-1)を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(V)で表されるアミン誘導体と反応させることにより、一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体を製造することができ、R<sup>3</sup>が水素原子以外の置換基を示すフタルアミド酸誘導体(VI-1)の場合、塩基の存在下又は不存在下、縮合剤の存在下に不活性溶媒中で一般式(V)で表されるアミン誘導体と縮合させることにより、一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体を製造することができる。

一般式(I)中のAの定義で、AがA1~A4を示し、A1~A4中のYが一 $G-R^7$ を示す場合、Gが-SO-又は $-SO_2$ -を示す化合物は、Yが-E-R $^6$ を示し、Eが-S-を示す化合物を常法により、例えばm-クロロ過安息香酸、過酸化水素等の酸化剤で酸化反応を行うことにより製造することができる。

20 2-1. 一般式(II-2)→一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)

本反応は製造方法(1-2)と同様にすることにより、目的物を製造することができる。

一般式(II-2)で表されるフタル酸無水物誘導体はJ. Org. Chem., <u>5</u> <u>2</u>, 129 (1987)、J. Am. Chem. Soc., 51, 1865 (1 929)、及びJ. Am. Chem. Soc., <u>63</u>, 1542 (1941)等に記載の方法により製造することができる。

2-2. 一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)→一般式(I)

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化

炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は 環状エーテル類、アセトニトリル等のニトリル類等の不活性溶媒を例示すること ができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができ る。

5 本反応で使用する縮合剤としては、通常のアミド製造に使用されるものであれば良く、例えば向山試薬(2-クロローNーメチルピリジニウムアイオダイド)、DCC(1,3-ジシクロヘキシルカルボジイニド)、CDI(カルボニルジイミダゾール)、DEPC(シアノリン酸ジエチル)等を例示することができ、その使用量は一般式(IV-1)又は一般式(IV-2)で表されるフタルアミド類に対して等10 モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は一般式(IV-1)又は一般式(IV-2)で表されるフタルアミド類に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

15 反応温度は0℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間 は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良 い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造する 20 ことができる。

2-3. 一般式(VI-1)→一般式(IV-1)又は一般式(VI-2)→一般式(IV-2)

本反応は、例えば J. Med. Chem., 10, 982 (1967) に記載 の方法に従って目的物を製造することができる。

2-4. 一般式(IV-1)又は一般式(IV-2)→一般式(I)

25 本反応は製造方法(1-2)と同様にすることにより、目的物を製造すること ができる。

以下に一般式(I) で表されるフタルアミド誘導体の代表的な化合物を第1表に 例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、表中、物性は融点 <sup>○</sup>
で又は性状を示し、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」は

15

プロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Ph」はフェニル基を、「Pyr」は ピリジル基を、「Thz」はチアゾリル基を示す。

一般式(I-2)

10

第1	表
----	---

州工权					
No	$R^3$	$R^4$	$X^1$	Yn	物性
1-1	F	$\mathrm{C_2F_5}$	Cl	Н	187
1-2	Me	$C_2F_5$	Cl	H	132
1-3	Me	$CF(CF_3)_2$	I	Н	228
1-4	Me	$\mathrm{C_2F_5}$	Cl	3-F	107
1-5	Me	$C_2F_5$	Cl	4-F	180
1-6	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	2-Cl	
1-7	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-Cl	
1-8	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-Cl	
1-9	Me	$CF(CF_3)_2$	I	2-I	246
1-10	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$2,6\text{-}\mathrm{F}_2$	260
1-11	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$2,4 ext{-}\mathrm{Cl}_2$	256
1-12	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3,5\text{-}\mathrm{Cl}_2$	264
1-13	Me	$\mathrm{C_2F_5}$	Cl	2-Me	205
1-14	Me	$C_2F_5$	Cl	3-Me	174
1-15	Me	$C_2F_5$	Cl	4-Me	196
1-16	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-Bu-t	236
1-17	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4\text{-}\mathrm{C}\text{=}\mathrm{CH}_2$	
1-18	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4-C \equiv CH$	
1-19	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4-C \equiv C-Bu-t$	
1-20	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-}\mathrm{CF}_3$	209

第1表 (続き)

No	$R^3$	$\mathbb{R}^4$	$X^1$	Yn	物性
1-21	Me	$\mathrm{OCF}_3$	F	$4\text{-CF}_3$	234
1-22	Me	$C_2F_5$	Cl	$2 ext{-Me-}4 ext{-C}_2 ext{F}_5$	219
1-23	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	112
1-24	Me	$CF(CF_3)_2$	Ι	$3\text{-CH}_2\text{OH}$	
1-25	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$	
1-26	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$	
1-27	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\text{OCONHEt}$	
1-28	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\text{OCONEt}_2$	
1-29	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\text{O-N=C(Me)}_2$	
1-30	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\text{OP}(=\text{O})(\text{OMe})_2$	
1-31	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{OPS}(\text{OMe})_2$	
1-32	Me	$CF(CF_3)_2$	I	2-CH <sub>2</sub> SMe	177
1-33	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\mathrm{SMe}$	142
1-34	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4$ -CH $_2$ SMe	215
1-35	Me	$CF(CF_3)_2$	. <b>I</b>	$4\text{-CH}_2\mathrm{SOMe}$	
1-36	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-CH}_2\mathrm{SO}_2\mathrm{Me}$	
1-37	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\mathrm{SO}_2\mathrm{NH}_2$	
1-38	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$3\text{-CH}_2\mathrm{SO}_2\mathrm{NHMe}$	
1-39	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	·I	$3\text{-CH}_2\mathrm{SO}_2\mathrm{NMe}_2$	
1-40	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$	

第1表 (続き)

No	$R^3$	${ m R}^4$	$X^1$	Yn	物性
1-41	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I		
1-42	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{N}^+\text{Me}_3\cdot\text{Cl}^-$	
1-43	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{NHCOMe}$	
1-44	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{NHCO}_2\textbf{Et}$	
1-45	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\text{NHSO}_2\text{Me}$	
1-46	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$4\text{-CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$	192
1-47	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-CH=CHCO}_2\text{Et}$	
1-48	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}C\!\equiv\!\text{CCO}_2\text{Et}$	
1-49	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{CN}$	
1-50	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-CH <sub>2</sub> CN	
1-51	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4$ -CH $_2$ CONH $_2$	
1-52	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-CH <sub>2</sub> CONHMe	
1-53	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-CH}_2\text{CONEt}_2$	
1-54	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{CH=NOMe}$	
1-55	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	3-CH <sub>2</sub> CH=NOCH <sub>2</sub> CH=CH	$\mathbf{I_2}$
1-56	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\text{CMe=NOMe}$	
1-57	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-CH}_2\mathrm{PO}(\mathrm{OMe})_2$	
1-58	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CH}_2\mathrm{PS}(\mathrm{OMe})_2$	
1-59	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-CH}_2\text{PO(OMe)}_2$	

19

第1表 (続き)

No	$R^3$	$\mathbb{R}^4$	$X^1$	Yn	物性
1-60	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$3 ext{-} ext{CH}_2 ext{SiMe}_3$	***************************************
1-61	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-СНО	
1-62	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-COMe	207
1-63	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-COMe	204
1-64	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CO}_2\mathrm{Et}$	198
1-65	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-CO}_2\mathrm{Me}$	135
1-66	Me	$CF(CF_3)_2$	Ι	$3\text{-CONH}_2$	152
1-67	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$4$ -CONH $_2$	160
1-68	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-CONHSO}_2\mathrm{Me}$	
1-69	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-}\mathrm{CONHSO}_2\mathrm{CF}_3$	
1-70	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-CN	185
1-71	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-CH=NOH	
1-72	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-CH=NOMe	
1-73	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-C(Me)=NOMe	
1-74	Me	$CF(CF_3)_2$	I	2-OMe	223
1-75	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-OMe	
1-76	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-OMe	232
1-77	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	4-OEt	217
1-78	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3,4$ -(OMe) $_2$	156
1-79	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$3,5$ -(OMe) $_2$	212

第1表 (続き)

No	$R^3$	$R^4$	$X^1$	Yn	物性
1-80	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3,4,5$ -(OMe) $_3$	218
1-81	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$3\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{O}\text{-}4$	205
1-82	Me	$\mathrm{OCF}_3$	$\mathbf{F}$	$3\text{-OCF}_3$	244
1-83	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-OCH}_2\text{-}(3\text{-Pyr})$	
1-84	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CH}\text{-}\mathrm{CH}_2$	
1-85	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-OCH}_2\text{CH=CH}_2$	
1-86	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	
1-87	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{C}\!\equiv\!\mathrm{CH}$	
1-88	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{F}$	
1-89	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH_2CH_2Cl}$	
1-90	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH_2CH_2CH_2C}$	l
1-91	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{OMe}$	
1-92	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{CH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{OM}$	e
1-93	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{SMe}$	
1-94	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH_2CH_2SMe}$	
1-95	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{SOMe}$	
1-96	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> M	e
1-97	Me	$CF(CF_3)_2$	. I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{SI}$	Ме
1-98	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$3\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CO}_2\mathrm{Me}$	
1-99	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4 ext{-} ext{OCH}_2 ext{CO}_2 ext{Et}$	

第1表 (続き)

No	$\mathbb{R}^3$	$R^4$	$X^1$	Yn	物性
1-100	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-}\mathrm{OCH_2CN}$	
1-101	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CN}$	
1-102	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{Ph}$	
1-103	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4\text{-OP(=O)(OMe)}_2$	
1-104	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4\text{-OP}(=S)(OMe)_2$	
1-105	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CH}\text{-}\mathrm{CCl}_2$	·
1-106	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{OCH}_2\mathrm{CONEt}_2$	
1-107	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	4-OC(=0)NHEt	
1-108	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-OC}(=\!\!\text{O})\text{NEt}_2$	
1-109	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-OPh	177
1-110	Me	$CF(CF_3)_2$	1	4-OPh	191
1-111	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-O-(2-SMe)Ph	
1-112	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-O-(3-SMe)Ph	
1-113	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-OP}(=0)(\mathrm{OMe})_2$	
1-114	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-OP}(=S)(\mathrm{OMe})_2$	
1-115	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-NMe}_2$	216
1-116	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-NHCOMe	255
1-117	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	4-NHCOMe	245
1-118	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-NHCOPh	
1-119	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-NHCO}_2\mathrm{Me}$	

第	1	表	(続き)	

No	$\mathbb{R}^3$	$R^4$	$X^1$	Yn	物性
1-120	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	3-NHCO <sub>2</sub> Et	
1-121	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-}NHCONMe_2$	
1-122	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-NHSO}_2\mathrm{Me}$	157
1-123	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Ι	3-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	•
1-124	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-NHSO}_2\text{Ph}$	
1-125	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-NHSO}_2\text{NHMe}$	
1-126	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-NHPO(OMe)}_2$	
1-127	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$3\text{-NHPS}(\mathrm{OMe})_2$	
1-128	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3\text{-NO}_2$	
1-129	Me	$CF(CF_3)_2$	I	2-SMe	219
1-130	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1	3-SMe	221
1-131	Me	$\mathrm{CH}(\mathrm{CF}_3)_2$	1	3-SMe	128
1-132	Me	$CF(CF_3)_2$	I.	4-SMe	214
1-133	Me	$\mathrm{CH}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	4-SMe	199
1-134	Me	$CF(CF_3)_2$	Ι	4-SOMe	アモルファス
1-135	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-SO}_2\mathrm{Me}$	アモルファス
1-136	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	4-SEt	201
1-137	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-SPr-i	210
1-138	Me	$CF(CF_3)_2$	I	2-Me-4-SMe	256
1-139	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-SCH}_2\text{CH=CH}_2$	

第1表 (続き)

77 1 20	(NYL C )	****			
No	$\mathbb{R}^3$	$R^4$	$X^1$	Yn	物性
1-140	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	3-SCH <sub>2</sub> C≡CH	
1-141	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	2-SCF <sub>3</sub>	188
1-142	Me	$CF(CF_3)_2$	I	3-SCF <sub>3</sub>	
1-143	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{SCH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{OMe}$	
1-144	Me	$CF(CF_3)_2$	Ι	$4\text{-SCH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$	
1-145	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-SCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$	
1-146	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{SCH}_2\mathrm{CONH}_2$	
1-147	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-}\mathrm{SCH}_2\mathrm{CONEt}_2$	
1-148	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-SCH}_2\text{PO(OMe)}_2$	
1-149	Me	$CF(CF_3)_2$	I	4-SC(=O)Me	
1-150	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	4-SC(=S)Me	
1-151	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4$ -SC(=O)NMe $_2$	
1-152	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4$ -SC(=S)NMe $_2$	
1-153	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$2\text{-SO}_2\mathrm{NH}_2$	263
1-154	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3-SO_2NH_2$	152
1-155	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4-SO_2NH_2$	230
1-156	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$3-SO_2$ NHMe	
1-157	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-SO}_2\mathrm{NHMe}$	238
1-158	Me	$CF(CF_3)_2$	1	$4$ -SO $_2$ NHE $_1$	147
1-159	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	4- SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH=CH	${f I_2}$

第1表 (続き)

No	R <sup>3</sup>	$R^4$	x <sup>1</sup>	Yn	物性
1-160	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	Ι	4-SO <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OM	e
1-161	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-SO}_2\mathrm{NMe}_2$	242
1-162	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-SO}_2\mathrm{NEt}_2$	176
1-163	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4$ -SO $_2$ NHCOMe	236
1-164	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4\text{-SO}_2\text{NHCOCF}_3$	
1-165	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-SO}_2\text{NH-}(2\text{-Pyr})$	182
1-166	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	$4\text{-SO}_2\text{NH-}(2\text{-Thz})$	215
1-167	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$2\text{-Cl-4-SO}_2\text{NH}_2$	197
1-168	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4\text{-SP}(=0)(\mathrm{OMe})_2$	
1-169	Me	$CF(CF_3)_2$	I	$4\text{-SP}(=\!\!\mathrm{S})(\mathrm{OMe})_2$	
1-170	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$4 ext{-SiMe}_3$	
1-171	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF_3})_2$	I	$4\text{-PO(OMe)}_2$	
1-172	Me	$\mathrm{CF}(\mathrm{CF}_3)_2$	I	4-PS(OMe) <sub>2</sub>	

## 一般式(I-3)

5

烘	$\mathbf{a}$	#
岃	Z	双

No	$\mathbb{R}^1$	$R^2$	$R^4$	$X^1$	Yn	物性
2-1	Me	Н	${f C_2F_5}$	Cl	Н	119
2-2	Me	Н	$C_2F_5$	Cl	3-Cl	^°- <b>7</b> }
2-3	Me	H	$\mathrm{OCHF}_2$	Cl	н .	130
2-4	H	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	3-SMe	^°-スト
2-5	H	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	4-SMe	アモルファス
2-6	H	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$4-SO_2NH_2$	165
2-7	Me	Me	$\mathrm{C_2F_5}$	C1	Н	アモルファス

## 一般式(I-4)

200	2	=
兂	J	ᅏ

No	$R^3$	R <sup>4</sup>	$X^1$	Yn	物性
3-1	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	Н	220
3-2	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	$2,4 ext{-Cl}_2$	248
3-3	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	4-SMe	154
3-4	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	2-Me-4-SMe	244
3-5	Me	CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	I	4-SMe-5-Cl	216

#### 実施例

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるも 5 のではない。

実施例 1.  $N^2$ -[2-(メチルチオ) フェニル] -3-ヨードー $N^1$ -{2-メチル -4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル} フタルアミド (化合物No. 1-129) の製造

- (1). 無水3-ヨードフタル酸2. 74gをアセトニトリル30mlに加え、
- 10 室温で攪拌下に2-メチルー4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル]アニリン2. 75gのアセトニトリル20ml溶液を15分かけて滴下した。滴下終了後、室温で1時間攪拌した後、析出した結晶を濾集し、少量のエーテルで洗浄することにより、6-ヨード-N-{2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチ

15 ル]フェニル}フタルアミド酸3.57gを得た。(収率:65%)

- (2). 6-ヨード-N-{2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}フタルアミド酸1.1gをメチルターシャリーブチルエーテル50mlに溶解し、無水トリフルオロ酢酸0.5gを加え、室温で2時間反応を行った。反応混合液を5%重曹水で洗浄し、無水0硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去することにより、N-{2-メ
- 20 硫酸マクネシリムで乾燥し、磁圧下に俗媒を留去することにより、N=(2-7)
  チルー4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロー1-(トリフルオロメチル) エ

(3). N-{2-メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル]フェニル}-3-ヨードフタル酸イソイミド0. 95g
 5 をアセトニトリル5m1に溶解し、4-(メチルチオ) アニリン0. 25g及びトリフルオロ酢酸10mgを加え、室温で2時間攪拌した。析出した結晶を濾集し、少量のエーテルで洗浄することにより、目的物1. 0gを得た。(収率:83%)

実施例2.  $N^2$ -[4-(メチルスルフィニル) フェニル]-3-ヨード- $N^1$ -{2 10 -メチル-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル]フェニル}フタルアミド(化合物No. 1-134) の製造

 $N^2$ -[4-(メチルチオ) フェニル]-3-ヨードー $N^1$ -{2-メチルー4-[1,2,2,2-デトラフルオロー1-(トリフルオロメチル) エチル]フェニル}フタルアミド0.34gをクロロホルム10mlに溶解し、0℃に冷却後、該溶液にメタクロロ過安息香酸0.1gを加えて室温下に1時間攪拌した。反応混合液を10%炭酸カリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。得られた残渣を酢酸エチルを溶離剤としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより、目的物0.3gを得た。(収率:87%)

本発明の一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稲、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana fasciata)、チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes orana fasciata)、チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes sp.)、リンゴコシンクイ(Grapholita inopinata)、ナシヒメシンクイ(Grapholita molesta)、マメシンクイガ(Leguminivora glycinivorella)、クワハマキ(Olethreutes mori)、チャノホソガ(Caloptilia thevivora)、リンゴホソガ(Caloptilia zachrysa)、キンモンホソガ(Phyllonorycter ringoniella)、ナシホソガ(Spulerrina astaurota)、モンシロチョウ(Piers rapae crucivora)、オオタバコガ類(Heliothis sp.)、コドリンガ(Laspey resia pomonella)、コナ

i v

ガ(Plutella xylostella)、リンゴヒメシンクイ(Argyresthia conjugella)、モ モシンクイガ(Carposina niponensis)、ニカメイガ(Chilo suppressalis)、コブ ノメイガ(Cnaphalocrocis medinalis)、チャマダラメイガ(Ephestia elutella)、 クワノメイガ(Glyphodes pyloalis)、サンカメイガ(Scirpophaga incertulas)、 5 イチモンジセセリ(Parnara guttata)、アワヨトウ(Pseudaletia separata)、イ ネヨトウ(Sesamia inferens)、ハスモンヨトウ(Spodoptera litura) 、シロイチ モジョトウ(Spodoptera egigua) 等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ (Macrosteles fascifrons)、ツマグロヨコバイ(Nephotettix cincticeps)、トビ イロウンカ(Nilaparvata lugens)、セジロウンカ(Sogatella furcifera) 、ミカ ンキジラミ (Diaphorina citri)、ブドウコナジラミ (Aleurolobus taonabae)、タ バココナジラミ(Bemisia tabaci)、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporariorum)、ニセダイコンアブラムシ(Lipaphis erysimi)、モモアカアブラ ムシ(Myzus persicae)、ツノロウムシ(Ceroplastes ceriferus)、ミカンワタカ イガラムシ(Pulvinaria aurantii) 、ミカンマルカイガラムシ(Pseudaonidia duplex)、ナシマルカイガラムシ(Comstockaspis perniciosa)、ヤノネカイガラ ムシ(Unaspis yanonensis)等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ(Pratylenchus sp.)、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、マメコガネ(Popilla japonica)、タバ コシバンムシ(Lasioderma serricorne)、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、 ニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintiotopunctata)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis)、ヤサイゾウムシ(Listroderes costirostris)、コ クゾウムシ(Sitophilus zeamais)、ワタミゾウムシ(Anthonomus grandis grandis)、イネミズゾウムシ(Lissorhoptrus oryzophilus) 、ウリハムシ (Aulacophora femoralis) 、イネドロオイムシ(Oulema oryzae) 、キスジノミハ ムシ(Phyllotreta striolata)、マツノキクイムシ(Tomicus piniperda)、コロ ラドポテトビートル(Leptinotarsa decemlineata) 、メキシカンビーンビートル 25 (Epilachna varivestis)、コーンルートワーム類(Diabrotica sp.)等の甲虫目害 虫、ウリミバエ (Dacus (Zeugodacus) cucurbitae) 、ミカンコミバエ (Dacus (Bactrocera) dorsalis) 、イネハモグリバエ (Agromyza oryzae) 、タマネ ギバエ(Delia antiqua)、タネバエ(Dalia platura)、ダイズサヤタマバエ

(Asphondylis sp.)、イエバエ(Musca domestica)、アカイエカ(Culex pipiens pipiens) 等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ(Pratylenchus coffeae)、ジャガイモシストセンチュウ(Glabodera rostchiensis)、ネコブセンチュウ (Meloidogyne sp.)、ミカンネセンチュウ(Tylenchulus semipenetrans)、ニセネグサレセンチュウ(Aphelenchus avenae)、ハガレセンチュウ(Aphelenchoides ritzemabosi)等のハリセンチュウ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。

本発明の一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を 10 与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に 15 製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

- 20 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、 固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、 鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、 粉砕合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白 土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類 {例えば珪藻
- 25 土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン(含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成 高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。)}、 活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、 炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロ・ ピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、燐安、硝安、尿素、

塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒 能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることとなるも 5 のから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは 単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類(例 えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコ ール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチル ケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(例えばエチ 10 ルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラ ン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例 えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン 等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭 素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソプピルフタレ 15 ート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメ チルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリ ル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることがで きる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これら 20 の補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用 し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性 剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレ ンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオ 25 キシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、 ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、 ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エス テル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に

例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

5 固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸 塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

10 防腐剤としては、1, 2 - ベンズイソチアゾリン-3 - オン、パラクロロメタ キシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等も添加することが出来る。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

15 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫 剤100重部中、0.01~90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、 例えば粉剤又は粒剤とする場合は0.01~50重量%、又乳剤又は水和剤とす る場合も同様0.01~50重量%が適当である。

本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適 20 宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測 される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001 g~10kg、好ましくは0.01g~1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除

草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例え ばエチオン、トリクロルホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロルボス、メ ビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカル 5 バム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレッド、 メチルパラチオン、フェニトロチオン、シアノホス、プロパホス、フェンチオン、 プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、 ジメチルビンホス、クロルフェビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イ ソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス ・メチル、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、 10 ホスメット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カ ズサホス、メスルフェンホス、DPS(NK-0795)、ホスホカルブ、フェ ナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェ ンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フ 15 ェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、 レスメトリン、ペルメトリン、テフルトリン、ビフェントリン、フェンプロパト リン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、シハロトリン、ラムダ・シハ ロトリン、デルタメトリン、アクリナトリン、フェンバレレート、エスフェンバ レレート、フルシトリネート、フルバリネート、シクロプロトリン、エトフェン **- プロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフェン、フルシトリネート、フ** ルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカ ルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカルブ、プロポキスル、フェノキシカ ルブ、フェノブカルブ、エチオフェンカルブ、フェノチオカルブ、ビフェナゼー ト、BPMC、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、 フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジ 25 フルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌ ロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズロン、酸化フェンブタスズ、水酸化 トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メトプ

レン、ハイドロプレン、ビナパクリル、アミトラズ、ジコホル、ケルセン、クロ

ルベンジレート、フェニソブロモレート、テトラジホン、ベンスルタップ、ベン ゾメート、テブフェノジド、メトキシフェノジド、クロマフェノジド、プロパル ギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナピル、 フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、 5 トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピ ラム、アセタミプリド、チアクロプリド、イミダクロプリド、チアメトキサム、 クロチアニジン、ニジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドラ メチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、TPIC (トリプロピ ルイソシアヌレート)、ピメトロジン、クロフェンテジン、ブプロフェジン、チ 10 オシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチ ン複合体、ミルベメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピ ノサッド、BT (バチルス・チューリンゲンシス)、アザディラクチン、ロテノ ン、ヒドロキシプロピルデンプン、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒 石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、バストリア、モナクロスポリウム ・フィマトパガム等の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤を例示することができ、 15 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤としては、例えば硫黄、石灰硫黄合剤、塩 基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラ ム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオファ ネート、チオファネートメチル、ベノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタ ジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、フラメトピル、 20 チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロパミド、ジクロフルア ニド、フルスルファミド、クロロタロニル、クレソキシム・メチル、フェノキサ ニル (NNF-9425)、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオルイミド、 プロシミドン、ビンクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、トリフルミゾ 25 ール、ビテルタノール、トリフルミゾール、イプコナゾール、フルコナゾール、 プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、ミクロブタニル、テトラコナゾール、 ヘキサコナゾール、テブコナゾール、イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフ ラゾエート、シプロコナゾール、イソプロチオラン、フェナリモル、ピリメタニ ル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジ

3

ン、アゾキシストロビン、チアジアジン、キャプタン、プロベナゾール、アシベンゾフラルーSーメチル (CGA-245704)、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネート、オキソリニック酸、ジチアノン、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシン、ブラストサイジン、ストレプトマイシン等の農園芸用殺菌剤を例示することができ、同様に除草剤としては、例えばグリホサート、スルホセート、グルホシネート、ビアラホス、ブタミホス、エスプロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニュロン、ダイムロン、ベンスルフロンーメチル、シクロスルファムロン、シノスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、リスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、ザニド、メフェナセット、ペンディメタリン、ビフェノックス、アシフルオフェン、ラクトフェン、シハロホップーブチル、アイオキシニル、ブロモブチド、アロキシジム、セトキシジム、ナプロパミド、インダノファン、ピラゾレート、ベンゾフェナップ、ピラフルフェン・エチル、イマザピル、スルフェントラゾン、カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサゾアゾン、パラコート、ジクワッ

15 カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサゾアゾン、パラコート、ジクワット、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメトリン、トリアジフラム、ベンフレセート、フルチアセット・メチル、キザロホップ・エチル、ベンタゾン、過酸化カルシウム等の除草剤を例示することができる。

又、生物農薬として、例えば核多角体ウイルス(Nuclear polyhedrosis virus、20 NPV)、顆粒病ウイルス(Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス(Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ポックスウイルス(Entomopox virus、EPV)等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム(Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ(Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ(Steinernema

25 kushidai)、パスツーリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans )等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobactor )、非病原性エルビニア・カロトボーラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis )等の殺

8 2 部

15部

菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

更に、生物農薬として例えばオンシツツヤコバチ (Encarsia formosa)、コレ 5 マンアブラバチ (Aphidius colemani)、ショクガタマバエ (Aphidoletes aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea)、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica)、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis)、ククメ リスカブリダニ (Amblyseius cucumeris)、ナミヒメハナカメムシ (Orius sauteri)等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (Beauveria

- brongniartii)等の微生物農薬、(Z) -10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z) -4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z) -8-ドデセニル=アセタート、(Z) -13-イコセン-10-オン、(Z) -8-ドデセニル=アセタート、(Z) -13-イコセン-10-オン、(Z) -11-テトラデセニル=アセタート、(Z) -11-テトラデセニル=アセタート、(Z) -13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。
  - 以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

## 製剤例1.

クレー粉末

珪藻土粉末

20	第1表乃至第3表記載の化合物	10部
	キシレン	70部
	Nーメチルピロリドン	10部
	ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
	アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
25	以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	
	製剤例2.	
	第1表乃至第3表記載の化合物	3 部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

製剤例3.

第1表乃至第3表記載の化合物

5部

ベントナイトとクレーの混合粉末

90部

5 リグニンスルホン酸カルシウム

5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。 製剤例4.

第1表乃至第3表記載の化合物

20部

カオリンと合成高分散珪酸

75部

10 ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物

5部

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

試験例1. コナガ(Plutella xylostella) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付い 15 たハクサイ実生を第1表乃至第3表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50 ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。 薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準 に従って判定を行った。1区10頭3連制

無処理区孵化虫数一処理区孵化虫数

20 補正死虫率(%)=--

 $-- \times 100$ 

無処理区孵化虫数

判定基準.

A···死虫率100%

B···死虫率99%~90%

C···死虫率89%~80%

25

D···死虫率79%~50%

E···死虫率49%以下

結果を第4表に示す。

試験例2. チャノコカクモンハマキ (Adoxophyes sp.) に対する殺虫試験 第1表乃至第3表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した

WO 02/094766 PCT/JP02/04744

37

薬液にチャ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレ に入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温 室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記式に従って死虫率を算出し、 試験例1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

無処理区生存虫数-処理区生存虫数

補正死虫率 (%) = ----×100

無処理区生存虫数

結果を第4表に示す。

5

第4表

Νο	試験例1	試験例2
1-1	A	A
1-2	A	A
1-3	A	E
1-4	Α	A
1-5	Α	E
1-9	A	A
1-10	A	E
1-11	Α	Α
1-12	Α	A
1-13	Α	E
1-14	A	E
1-15	Α	E
1-16	Α	A
1-20	Α	A
1-21	Α	E
1-22	Α	A
1-32	Α	A
1-33	A	Α
1-34	Α	A
1-46	A	A
1-62	A	Α
1-63	A	A

第4表 (続き)

N o	試験例1	試験例 2
1-65	A	Α
1-66	Α	Α
1-67	Α	Α
1-74	Α	Α
1-76	Α	Α
1-77	Α	Α
1-78	Α	Α
1-79	Α	E
1-80	Α	E
1-81	Α	A
1-109	Α	E
1-110	Α	E
1-115	Α	Α
1-116	Α	Α
1-117	Α	Α
1-122	Α	Α
1-129	Α	Α
1-130	Α	Α
1-131	Α	Α
1-132	Α	Α
1-133	A	A

第4表 (続き)

	試験例1	試験例2
1-134	Α	A
1-135	A	Α
1-136	Α	Α
1-137	Α	Α
1-138	A	A
1-141	A	Α
1-153	A	Α
1-154	A	E
1-155	A	Α .
1-157	A	Α
1-158	Α	Α
1-161	A	A
1-162	Α	A
1-163	A	A
1-165	Α	Α
1-166	A	E
1-167	A	Α
2-1	A	Α
2-2	A	A
2-4	A	Α
2-5	A	A
2-6	A	E

\*

WO 02/094766 PCT/JP02/04744

41

第4表 (続き)

N o	試験例1	試験例 2
2-7	A	A
3-1	A	A
3-2	A	A
3-3	A	A
3-4	A	A
3-5	A	E

## 請求の範囲

 ${\rm {dh}} {\rm {Ch}} {\rm {Ch}}$ C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコ キシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アル キル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコ キシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフ ィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、ハ 15 ロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₄アルキル基を示す。R³はハロ ゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ 基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基を示す。 $R^4$ はハロゲン原子、 ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシハロC<sub>9</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ基、ハロC1-C6アルキルチオ基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、 ハロC1-C6アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハ ロゲン原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ 25  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスル ホニル基又はハロC1-C6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を 有する置換フェノキシ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、 ハロゲン原子、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハ

 $X^1$ はハロゲン原子、ニトロ基、アミノ基、シアノ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ 15  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル基、ハロ $C_2$ - $C_6$ アルケニル基、 $C_2$ - $C_6$ アルキニ ル基、ハロ $C_2$ - $C_6$ アルキニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、  $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ ア 20 ルキルスルホニル基を示す。 $X^2$ は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、アミノ 基、シアノ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル基、ハ  $□C_2-C_6$ アルケニル基、 $C_2-C_6$ アルキニル基、 $\bigcirc \square C_2-C_6$ アルキニル基、 $\bigcirc \square C_1-C_6$ アル コキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチ オ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基を示す。又、 $X^1$ 及び 25  $X^2$ は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アル キルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、

 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有することもできる。

AはA1~A4

(式中、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケ ニル基、Co-Coアルキニル基、ハロCo-Coアルキニル基、Co-Coシクロアルキル基、 10 フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、 メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニ ル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基から選択 される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても 15 良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニト 口基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、ハロC1-C6アルキルチオ基、C1-C6アルキル スルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル 基又はハロC1-C6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する 置換複素環基、 $-E-R^6$  (式中、Eは-O-、-S-又は-N ( $R^7$ ) - (式中、  $R^7$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_3$ - $C_6$ アルケニル基、 $C_3$ - $C_6$ アルキニル基、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ $C_1$ -C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基、 **25**  $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノカルボニル基、同一又 は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニ ル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基、モノC1-C6アルキルアミノスルホニル基、 同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノスルホニル基、フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ア ルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミ

ノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキ ル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフ ィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1$ -5 C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フ ェニル $C_1$ - $C_4$ アルキル基を示す。)を示し、 $R^6$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハ  $ロC_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_3$ - $C_6$ アルケニル基、 $ハロC_3$ - $C_6$ アルケニル基、 $C_3$ - $C_6$ アルキ ニル基、ハロ $C_3$ - $C_6$ アルキニル基、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、フェニル基、同一又は異な 10 っても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、 ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスル ホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基又はC1-C6アルコキシカルボニル基か 15 ら選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル $C_1$ - $C_4$ アルキル 基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカ プト基、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル チオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ -20  $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシ カルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC1-C4 アルキル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、 アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア ルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 25  $ハロC_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $ハロC_1$ - $C_6$ アルキルス ルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又 は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複 素環基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルカルボニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルカルボニル基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルコキシカルボニル基、モノ $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノカルボニル基、同一又は異な

っても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、 ハロC1-C6アルキルスルホニル基、モノC1-C6アルキルアミノスルホニル基、同一 又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノスルホニル基、同一又は異なっても 良いジC1-Ccアルコキシホスホリル基又は同一若しくは異なっても良いジC1-Ccア 5 ルコキシチオホスホリル基を示す。)、 $-G-R^8$  (式中、Gは $-SO_2-$ 、-SO-、-C (=O) -又は-C (=NO $-R^7$ ) - (式中、 $R^7$ は前記に同じ。) を示し、 $R^8$ は水素原子、ヒドロキシ基、アミノ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、C3-C6アルケニル基、ハロC3-C6アルケニル基、C3-C6アルキニル基、 ハロC3-C6アルキニル基、C3-C6シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっ 10 ても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、 ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスル ホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異な っても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、 ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロ  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ ア ルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスル 20 ホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基又はC1-C6アルコキシカルボニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換複素環基、C1-C6アルコキシ基、C1-C6 アルキルチオ基、モノC1-C6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC1-C6 アルキルアミノ基、モノCa-Caアルケニルアミノ基、同一又は異なっても良いジ アルケニルアミノ基、モノC3-C6アルキニルアミノ基、C3-C8シクロアルキルアミ ノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ルアミノ基、C1-C6アルキルスルフィニルC1-C6アルキルアミノ基、C1-C6アルキル スルホニルC1-C6アルキルアミノ基、C1-C6アルキルカルボニルアミノ基、ハロC1-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキルスルホニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハ

ロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコ キシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフ ィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハ 5  $\text{<math>C_1-C_6}$ アルキルスルホニル基又は $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルコキシカルボニル基から選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、フェニルカルボニルアミ ノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メル カプト基、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキ 10 ルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキ シカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカル ボニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロ ゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-15  $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ 基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニ ル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシカルボニル基から選択される1以 上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニルアミノ基、複素環アミノ基又 20 は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メル カプト基、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキ ルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、  $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキ 25 シカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環アミノ基を示 す。)、 $-J-E-R^6$ (式中、Jは $C_1$ - $C_6$ アルキレン基、 $C_2$ - $C_6$ アルケニレン基又 は $C_2$ - $C_6$ アルキニレン基を示し、E及び $R^6$ は前記に同じ。)又は $-J-G-R^8$ (式中、J、G及びR<sup>8</sup>は前記に同じ。)を示す。

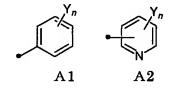
又、芳香環上に隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、

該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

nは0~3の整数を示す。)を示す。)で表されるフタルアミド誘導体。

2.  $R^1$ 及び $R^2$ が同一又は異なっても良く、水素原子又は $C_1$ - $C_6$ アルキル基を示し、 $R^3$ がハロゲン原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基又は $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基を示し、 $R^4$ がハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基又はハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基を示し、 $R^5$ が水素原子を示し、 $X^1$ がハロゲン原子を示し、 $X^2$ が水素原子を示し、

## AがA1またはA2



(式中、Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 15  $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $-E-R^6$  (式中、Eは-O-、-S-又は-N ( $R^7$ ) -(式中、 $R^7$ は水素原子、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_3$ - $C_6$ アルケニル基、 $C_3$ - $C_6$ アルキニ ル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ルチオC1-C6アルキル基、C1-C6アルキルカルボニル基、ハロC1-C6アルキルカルボ 20 ニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、 同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノカルボニル基、C1-C6アルキルス ルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノスルホ ニル基、同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノスルホニル基、フェニ ルC1-C1アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキ 25 シ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル チオ基、ハロC1-C6アルキルチオ基、C1-C6アルキルスルフィニル基、ハロC1-C6ア ルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホ ニル基又はC1-C6アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上

に有する置換フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基を示す。)を示し、R<sup>6</sup>は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア ルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、フェニル基、同 5 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、 シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ 基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニ 10 ル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ア ルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、 メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、  $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニ 15 ル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニ ルC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒド ロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、 ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アル 20 キルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルス ルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を 有する置換複素環基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニ ル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、 25 同一又は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルス ルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノスルホ ニル基、同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノスルホニル基、同一又 は異なっても良いジC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシホスホリル基又は同一若しくは異なっても 良い $\mathcal{C}_1$ - $\mathcal{C}_6$ アルコキシチオホスホリル基を示す。)、 $-G-R^8$  (式中、Gは-

 $SO_2$ -、-SO-、-C (=O) -又は-C (=NO-R<sup>7</sup>) - (式中、R<sup>7</sup>は 前記に同じ。)を示し、R<sup>8</sup>は水素原子、ヒドロキシ基、アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、ハロC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基、フェニル基、 5 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト 基、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコ キシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、ハロC1-C6アルキルチオ 基、C1-C6アルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6ア ルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカル 10 ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、 シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ 基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ 15 ルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニ ル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、モノC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、モノC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルアミノ基、同一又は異なっても良 いジアルケニルアミノ基、モノC3-C6アルキニルアミノ基、C3-C8シクロアルキル アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ア ルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アル キルスルホニルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、ハ ロC1-C6アルキルカルボニルアミノ基、C1-C6アルキルスルホニルアミノ基、ハロ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良 25 く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ 基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6ア ルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルス ルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、 ハロC1-C6アルキルスルホニル基又はC1-C6アルコキシカルボニル基から選択され

る1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、フェニルカルボニルア ミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メ ルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>- $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキルチオ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アル 5 キルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキ シカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルカル ボニルアミノ基、フェニルスルホニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロ ゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メルカプト基、シアノ基、ニトロ基、C-10  $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルコキシ 基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィニ ル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、ハロC1-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基から選択される1以 上の置換基を環上に有する置換フェニルスルホニルアミノ基、複素環アミノ基又 15 は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アミノ基、メル カプト基、シアノ基、ニトロ基、 $C_1$ - $C_6$ アルキル基、ハロ $C_1$ - $C_6$ アルキル基、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルチオ基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキ ルチオ基、C1-C6アルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基、ハロC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホニル基又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキ 20 シカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環アミノ基を示 す。)、 $-J-E-R^6$ (式中、 $JはC_1-C_6$ アルキレン基、 $C_2-C_6$ アルケニレン基又 は $C_2$ - $C_6$ アルキニレン基を示し、E及び $R^6$ は前記に同じ。)又は $-J-G-R^8$ (式中、J、G及び $R^8$ は前記に同じ。) で示される請求項1記載のフタルアミ ド誘導体。

- 25 3. 請求項1又は2いずれか1項記載のフタルアミド誘導体を有効成分として 含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。
  - 4. 有用植物から有害生物を防除するために、請求項3記載の農園芸用殺虫剤の有効量を対象植物又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用 方法。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP02/04744

	The second secon		
	SIFICATION OF SUBJECT MATTER .Cl <sup>7</sup> C07C233/66, 233/75, 233/76 311/08, 311/39, 317/40, 32		
	311/08, 311/39, 317/40, 32 A01N37/30, 37/40, 41/06, 4	23/29, 323/31, COIDELS, 41/10 43/40	15,
	to International Patent Classification (IPC) or to both n		
	OS SEARCHED		
Minimum a	documentation searched (classification system followed .C1 <sup>7</sup> C07C233/66, 233/75, 233/76	by classification symbols)	255/60
4110.	311/08, 311/39, 317/40, 32		
	A01N37/30, 37/40, 41/06, 4		,
Dogumental	tion searched other than minimum documentation to the	a autant that such documents are included	in the fields searched
Doong	NOI SCHOOL CHICA THAIR IMMINISTRATION	C CAICILI mat guon documents and annual	III IIIo Horas contente
	data base consulted during the international search (nam		rch terms used)
CAPL	LUS(STN), CAOLD(STN), REGISTRY(	(STN)	
= 2001	TO THE PERSON OF		
	IMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		<u> </u>
Category*	Citation of document, with indication, where ap	propriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Х	JP 48-42209 B1 (Toray Indust	ries, Inc.),	1
	11 December, 1973 (11.12.73), Page 6; table 2	′	i
	(Family: none)		•
_	_		1
A	EP 919542 A2 (Nihon Nohyaku 02 June, 1999 (02.06.99),	Co., Ltd.),	1-4
	02 June, 1999 (02.06.99),   Claims		I
	& CZ 9803799 A3	9893292 A	
ļ	& ZA 9810677 A & HU	J 9802725 A2	ı
	& CN 1222506 A & JP & BR 9805060 A & KR	2 11-240857 A 2 99045504 A	
	& US 2001/0041814 A1 & US	6362369 B1	
	1		
	l		
	1		
	1		
	<u></u> _		
Furthe	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.	
	l categories of cited documents: ent defining the general state of the art which is not	"T" later document published after the inte- priority date and not in conflict with th	
conside	ered to be of particular relevance document but published on or after the international filing	understand the principle or theory under "X" document of particular relevance; the c	erlying the invention
date		considered novel or cannot be consider	red to involve an inventive
cited to	ent which may throw doubts on priority claim(s) or which is o establish the publication date of another citation or other	step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the c	claimed invention cannot be
	reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or other	considered to involve an inventive step combined with one or more other such	
means	ent published prior to the international filing date but later	combination being obvious to a person "&" document member of the same patent f	skilled in the art
than the	e priority date claimed	•	
	actual completion of the international search	Date of mailing of the international search 03 September, 2002	
13 A	ugust, 2002 (13.00.02)	U3 September, 2002	(03.09.02)
Name and m	nailing address of the ISA/	Authorized officer	
	nailing address of the ISA/ inese Patent Office	Authorized officer .	
		-···	
Facsimile No.		Telephone No.	

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC)) Int. Cl. <sup>7</sup> C07C233/66, 233/75, 233/76, 233/80, 233/81, 237/42, 255/60, 311/08, 311/39, 317/40, 323/29, 323/37, C07D213/75, A01N37/30, 37/40, 41/06, 41/10, 43/40				
D 調本シ	テーた公邸			
調査を行った。 Int. Cl. 'CO'	B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC)) Int. Cl. CO7C233/66, 233/75, 233/76, 233/80, 233/81, 237/42, 255/60, 311/08, 311/39, 317/40, 323/29, 323/37, CO7D213/75, A01N37/30, 37/40, 41/06, 41/10, 43/40			
最小限資料以外	最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの			
ーーーー 国際調査で使り		調査に使用した用語)		
CAP	LUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)		·	
	ると認められる文献			
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連する。	ときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号	
Х	JP 48-42209 B1(東レ株式会社) 1973 (ファミリーなし)	3.12.11 第6頁第2表	1	
A	A EP 919542 A2 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 1999.06.02 特許請求の範囲 &CZ 9803799 A3 &AU 9893292 A &ZA 9810677 A &HU 9802725 A2 &CN 1222506 A &JP 11-240857 A &BR 9805060 A &KR 99045504 A &US 2001/0041814 A1 &US 6362369 B1		1-4	
□ C欄の続き	きにも文献が列挙されている。	□ パテントファミリーに関する別	紙を参照。	
もの 「E」国際出版 以後先権 「L」優先権 文献 で 「O」口頭に	のカテゴリー 車のある文献ではなく、一般的技術水準を示す 質日前の出願または特許であるが、国際出願日 公表されたもの 主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 くは他の特別な理由を確立するために引用する 理由を付す) よる開示、使用、展示等に言及する文献 質日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願	の日の後に公表された文献 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 13.08.02		国際調査報告の発送日 03.09.02		
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		特許庁審査官(権限のある職員) 爾見 武志 電話番号 03-3581-1101	- T	